

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2005年4月7日 (07.04.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/030960 A1

(51) 国際特許分類: C12N 15/11, A61K 48/00, 31/713,
A61P 37/00, 17/00, 9/00, 13/10, 13/12, 13/08, 13/02, 1/04

[JP/JP]; 〒5650851 大阪府吹田市千里山西 1-41-
4 Osaka (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/014694

(74) 代理人: 古谷聰, 外 (FURUYA, Satoshi et al.); 〒
1030007 東京都中央区日本橋浜町 2-17-8 浜
町花長ビル 6 階 Tokyo (JP).

(22) 国際出願日: 2004年9月29日 (29.09.2004)

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可
能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,
BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,
NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,
SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(25) 国際出願の言語: 日本語

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可
能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD,
SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ヨーラシア (AM, AZ, BY,
KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG,
CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE,
IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF,
BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN,
TD, TG).

(26) 国際公開の言語: 日本語

添付公開書類:
— 國際調査報告書

(30) 優先権データ:
特願2003-341419 2003年9月30日 (30.09.2003) JP

2文字コード及び他の略語については、定期発行される
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイドスノート」を参照。

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): アン
ジェス MG 株式会社 (ANGES MG, INC.) [JP/JP]; 〒
5670085 大阪府茨木市彩都あさぎ七丁目7番15号
Osaka (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 桜庭 康夫
(KUNUGIZA, Yasuo) [JP/JP]; 〒5650873 大阪府吹田
市藤白台1-1-14-402 Osaka (JP). 富田 泰
留也 (TOMITA, Naruya) [JP/JP]; 〒5430051 大阪府大
阪市天王寺区四天王寺1-5-45 Osaka (JP). 橋
本 英雄 (HASHIMOTO, Hideo) [JP/JP]; 〒5460043 大
阪府大阪市東住吉区駒川3-20-18-801
Osaka (JP). 吉川 秀樹 (YOSHIKAWA, Hideki) [JP/JP];
〒5600004 大阪府豊中市少路2-111-1-
605 Osaka (JP). 森下 龍一 (MORISHITA, Ryuichi)

(54) Title: STAPLE TYPE OLIGONUCLEOTIDE AND DRUG COMPRISING THE SAME

(54) 発明の名称: ステイブル型オリゴヌクレオチドおよびそれからなる医薬

(57) **Abstract:** It is intended to provide an oligonucleotide and a drug to thereby solve problems occurring in existing oligonucleotides, for example, being unstable because of being opened at both ends, and showing toxicity caused by phosphorothioate when modified with phosphorothioate (S-modification) to elevate the stability to digesting enzymes. More specifically speaking, a staple type oligonucleotide and a drug containing the same as the active ingredient. More particularly, a transcriptional factor inhibitor, an antisense oligonucleotide or an siRNA, in greater detail, a drug for preventing, treating or improving inflammation, autoimmune diseases, central diseases, reperfusion injury in ischemic diseases, worsened prognosis after organ transplantation or organ operation or restenosis after PTCA. Still specifically speaking, a drug for preventing, treating or improving arthritis, dermatitis, nephritis, hepatitis, renal failure, cystitis, prostatitis, urethritis, ulcerative colitis, Crohn's disease, rheumatoid arthritis or arthritis deformans, atopic dermatitis, contact dermatitis, psoriasis, skin ulcer or bed sore.

(57) 要約: 本発明は、従来型のオリゴヌクレオチドは両端が開放になっているために不安定であること、ホスホロ
チオエート化(S化)修飾により分解酵素に対する安定性高めることも行われているがホスホロチオエートに起因する
毒性が生じることなどの問題点を改善したオリゴヌクレオチドと医薬を提供する。詳しくは、ステイブル型オリゴ
ヌクレオチドおよびそれを有効成分とする医薬。具体的には転写因子阻害剤、アンチセンスオリゴヌクレオチドま
たはsiRNAであり、より具体的には炎症、自己免疫疾患、中枢性疾患、虚血性疾患の再灌流障害、臓器移植又は臓
器の手術後の予後の悪化またはPTCA後の再狭窄の予防・治療・改善剤であり、さらに具体的には関節炎、皮膚炎、
腎炎、肝炎、腎不全、膀胱炎、前立腺炎、尿道炎、潰瘍性大腸炎またはクローン病、慢性関節リウマチまたは変形
性関節症、アトピー性皮膚炎、接触性皮膚炎、乾癬、皮膚潰瘍または褥瘍の予防・治療・改善剤である。

WO 2005/030960 A1